

09/889341

5000

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES  
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum  
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum  
12. Oktober 2000 (12.10.2000)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer  
WO 00/59883 A3

(51) Internationale Patentklassifikation<sup>7</sup>: C07D 209/08, 207/32, 209/42, 249/20, 209/12, 233/60, 235/06, 231/56, 209/86, 249/06, 249/08, 401/04, 295/08, C07C 217/20, 205/37, 211/52, 205/56

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von US): GÖDECKE GMBH [DE/DE]; Pfizerstrasse 1, 76139 Karlsruhe (DE).

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP00/01574

(72) Erfinder; und

(22) Internationales Anmeldedatum:  
25. Februar 2000 (25.02.2000)

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): BARTH, Hubert [DE/DE]; Bertolt-Brecht-Weg 6, D-79312 Emmendingen (DE). STEINER, Klaus [DE/DE]; Jörg-Erb-Weg 6, D-79312 Emmendingen (DE). BETCHE, Hans-Jürgen [DE/DE]; Im Gottesacker 8, D-79279 Vörstetten (DE). SCHNEIDER, Simon [DE/DE]; Alte Strasse 28a, D-79249 Merzhausen (DE). BAYER, Ulrich [DE/DE]; Weickmannstrasse 25, D-89077 Ulm (DE). WESTER-MAYER, Manfred [DE/DE]; Kandelstrasse 62, D-79194 Gundelfingen (DE). WOLFSPERGER, Ulrike [DE/DE]; Gewerbestrasse 84, D-79194 Gundelfingen (DE).

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

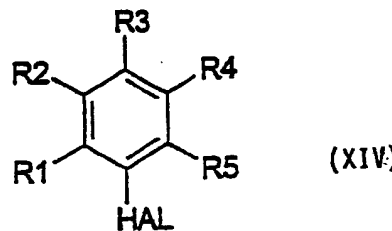
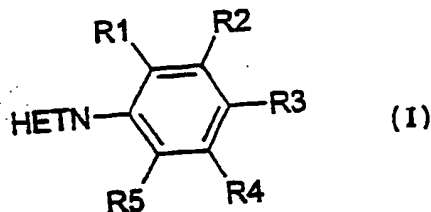
(30) Angaben zur Priorität:  
199 14 610.1 30. März 1999 (30.03.1999) DE

(74) Anwälte: MANSMANN, Ivo usw.; Gödecke GmbH, Mooswaldallee 1, 79090 Freiburg (DE).

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

(54) Title: METHOD FOR PRODUCING N-ARYL-AZA-HETEROCYCLES IN THE PRESENCE OF CESIUM CARBONATE

(54) Bezeichnung: VERFAHREN ZUR HERSTELLUNG VON N-ARYL-AZA-HETEROCYCLN IN GEGENWART VON CESIUMCARBONAT



(57) Abstract: The invention relates to a method for producing N-aryl-aza-heterocycles of general formula (I) in which: R1, R2, R3, R4 and R5 are the same or different and represent a hydrogen atom, a nitro group, a cyano group, an alkoxy carbonyl group with up to 5 C atoms, an aldehyde group, an alkylcarbonyl group with up to 5 C atoms, an arylcarbonyl group or an amide group, whereby the radicals R1 to R5 can not all be a hydrogen atom at the same time, and; HETN represents an aromatic aza-heterocycle with 5 or 6 ring atoms, whereby up to 3 ring atoms can be nitrogen atoms, and up to two additional aromatic carbon rings can be fused to the heterocycle. The inventive N-aryl-aza-heterocycles are produced by reacting, at room temperature, aza-heterocycles with activated aromatic compounds of general formula (XIV), in which HAL represents a halogen atom, while using cesium carbonate and without adding additional catalysts.

(57) Zusammenfassung: Die Erfindung betrifft ein Verfahren zur Herstellung von N-Aryl-Aza-Heterocyclen der allgemeinen Formel (I) in der R1, R2, R3, R4 und R5 gleich oder verschieden sind und ein Wasserstoffatom, eine Nitrogruppe, eine Cyanogruppe, eine Alkoxy carbonylgruppe mit bis zu 5 C Atomen, eine Aldehydgruppe, eine Alkylcarbonylgruppe mit bis zu 5 C-Atomen, eine Arylcarbonylgruppe oder eine Amidgruppe bedeuten, wobei die Reste R1 bis R5 nicht alle gleichzeitig ein Wasserstoffatom sein können, und HETN einen aromatischen Aza-Heterocyclen mit insgesamt 5 oder 6 Ringatomen bedeutet, wobei bis zu 3 Ringatome Stickstoffatome sein können, und bis zu zwei weitere aromatische Kohlenstoffringe am Heterocyclen ankondensiert sein können, durch Reaktion von Aza-Heterocyclen mit aktivierten Aromaten der allgemeinen Formel (XIV) in der HAL für ein Halogenatom steht, unter Verwendung von Cesiumcarbonat ohne Zusatz von weiteren Katalysatoren bei Raumtemperatur.

WO 00/59883 A3



(81) **Bestimmungsstaaten (national):** AE, AL, AU, BA, BB, BG, BR, CA, CN, CR, CU, CZ, DM, EE, GD, GE, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KP, KR, LC, LK, LR, LT, LV, MA, MG, MK, MN, MX, NO, NZ, PL, RO, SG, SI, SK, TR, TT, UA, US, UZ, VN, YU, ZA.

(84) **Bestimmungsstaaten (regional):** ARIPO-Patent (GH, GM, KE, LS, MW, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZW), eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), OAPI-Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

**Veröffentlicht:**

— mit internationalem Recherchenbericht

(88) **Veröffentlichungsdatum des internationalen**

**Recherchenberichts:**

13. September 2001

*Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes, und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der PCT-Gazette verwiesen.*